

Anlage zu EPA Form 2004, Mitteilung gemäß Regel 51(4) EPÜ

Bibliographische Daten der europäischen Patentanmeldung Nr. 05 700 961.5

Für die beabsichtigte Erteilung eines europäischen Patents werden nachfolgend die bibliographischen Daten zur Information mitgeteilt:

- Bezeichnung:** - 6-(2-CHLOR-5-HALOGENPHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINE,
VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG
ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE
MITTEL
- 6-(2-CHLORO-5-HALOPHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINE, METHOD
FOR PRODUCTION AND USE THEREOF FOR CONTROLLING
FUNGAL PESTS AND AGENTS COMPRISING THE SAME
- 6-(2-CHLORO-5-HALOGENEPHENYL)-TRIAZOLOPYRIMIDINES,
PROCEDE DE PRODUCTION DESDITS COMPOSES ET LEUR
UTILISATION POUR LUTTER CONTRE LES CHAMPIGNONS
PARASITES, ET AGENTS CONTENANT LESDITS COMPOSES
- Klassifikation:** INV. C07D487/04 A01N43/90
- Anmeldetag:** 15.01.2005
- Beanspruchte Priorität:** DE / 23.01.2004 / DEA102004003732
DE / 19.10.2004 / DEA102004051101
- Vertragsstaaten*, für die Gebühren bezahlt wurden:** AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IS IT LI LT LU MC
NL PL PT RO SE SI SK TR
- Erstreckungsstaaten*, für die Gebühren bezahlt wurden:** AL BA HR LV MK YU
- Anmelder**:** BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
DE
- Erfinder:** TORMO I BLASCO, Jordi
Carl-Benz-Str. 10-3
69514 Laudenbach
DE
- BLETTNER, Carsten
Richard-Wagner-Str. 48
68165 Mannheim
DE
- MÜLLER, Bernd
Stockinger Str. 7
67227 Frankenthal
DE

GEWEHR, Markus
Goethestr. 21
56288 Kastellaun
DE

GRAMMENOS, Wassilios
Alexander-Fleming-Str. 13
67071 Ludwigshafen
DE

GROTE, Thomas
Im Höhnhausen 18
67157 Wachenheim
DE

RHEINHEIMER, Joachim
Merziger Str. 24
67063 Ludwigshafen
DE

SCHÄFER, Peter
Römerstr. 1
67308 Ottersheim
DE

SCHIEWECK, Frank
Lindenweg 4
67258 Hessheim
DE

SCHWÖGLER, Anja
Heinrich-Lanz-Str. 3
68165 Mannheim
DE

WAGNER, Oliver
Im Meisental 50
67433 Neustadt
DE

SCHERER, Maria
Hermann-Jürgens-Str. 30
76829 Landau-Godramstein
DE

STRATHMANN, Siegfried
Donnersbergstr. 9
67117 Limburgerhof
DE

SCHÖFL, Ulrich
Erlenstr. 8
68782 Brühl
DE

STIERL, Reinhard
Jahnstr. 8
67251 Freinsheim
DE

- | |
|--|
| <p>*) Sind Fristen gemäß Artikel 79(2) und Regel 85a EPÜ noch nicht abgelaufen, dann sind alle Vertragsstaaten/Erstreckungsstaaten genannt.</p> <p>**) Falls zwei oder mehrere Anmelder verschiedene Vertragsstaaten benannt haben, ist dies hier angegeben.</p> |
|--|

6-(2-Chlor-5-halogenphenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Halogencycloalkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₂-C₈-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15

20 R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteraryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₄-C₆-Alkylenoxy und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann;

25 R¹ und/oder R² können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

30 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Halogenalkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkenoxy, C₁-C₃-Oxyalkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

35

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylothio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

10 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

15 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylothio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetarylloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können;

20 L¹ Fluor, Chlor oder Brom;

25 L² Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy; und

30 X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

35 Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113 sind 5-Chlor-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In EP-A 550 113, FR-A 27 84 991, US 5 994 360, WO 98/46608, JP-A 2002/308 879, WO 02/38565, WO 02/083677, WO 02/088125, WO 02/088126 und WO 02/088127 werden 6-(2-Cl-Phenyl)-7-amino-triazolopyrimidine allgemein vorgeschlagen, deren 6-Phenylgruppe eine weitere Halogensubstitution aufweist. Triazo-

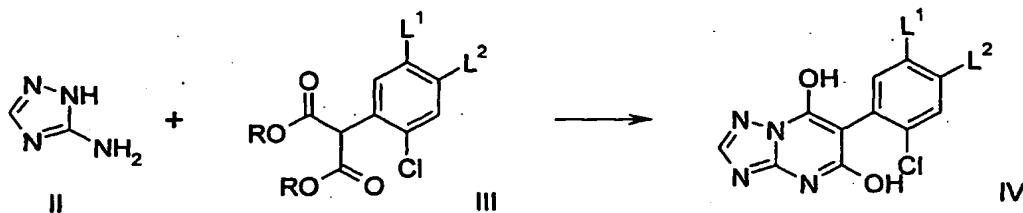
Iopyrimidine, in denen die 6-Phenylgruppe 4-Alkyl- oder 4-Alkoxy-substituenten trägt, sind aus WO 98/48893, WO 03/008417 und WO 03/093271 bekannt. Diese Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in den vorgenannten Schriften beschriebenen durch die 2,5-Disubstitution des 6-Phenylringes.

Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel III, in der R für Alkyl, bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, dargestellt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

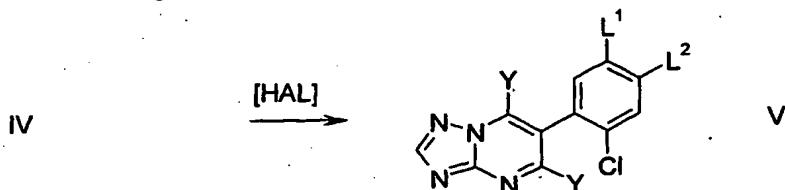
Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallocide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat III in einem Überschuss bezogen auf das Triazol einzusetzen.
- Phenylmalonate der Formel III werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

- Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel IV werden unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel V überführt, in der Y ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxybromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.



Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

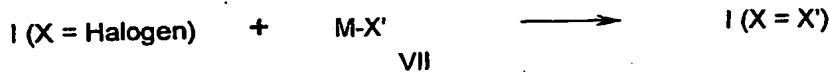
- Dihalogenpyrimidine der Formel V werden mit Aminen der Formel VI,

5



in der R¹ und R² wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, weiter umgesetzt.

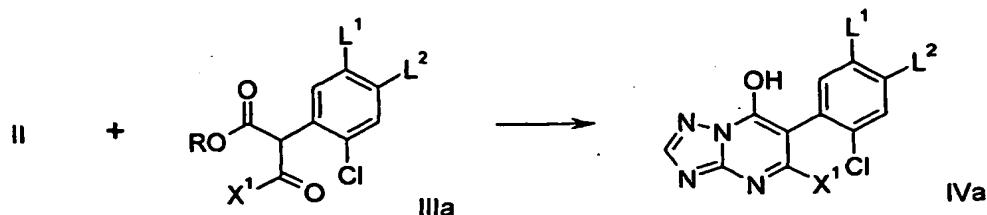
- 5 Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].
- 10 Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VI kann als Base dienen.
- 15 Verbindungen der Formel I, in der X Cyano, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy bedeutet, können vorteilhaft aus der Umsetzung von Verbindungen I, in der X Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen M-X' (Formel VII) erhalten werden. Verbindungen VII stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel VII hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.
- 20



- Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

- Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, Alkohole, wie Methanol oder Ethanol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol oder Acetonitril.
- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

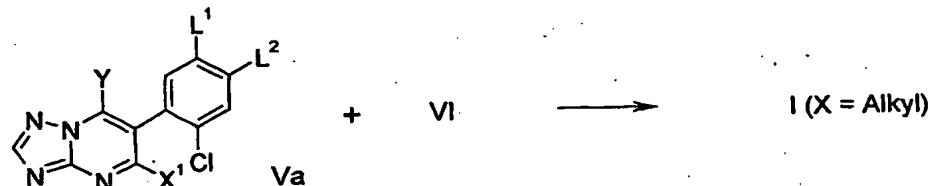
6



Ausgehend von den Ketoestern IIIa werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine IVa erhalten. In Formeln IIIa und IVa steht X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogensubstituuenten. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (IIIa mit 5

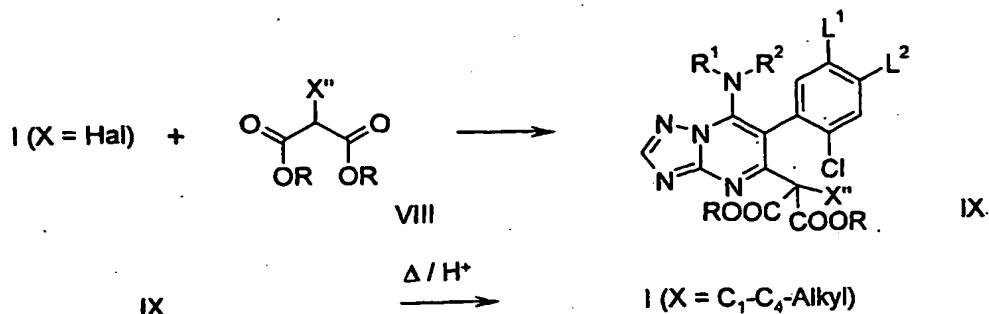
X¹=CH₃) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen IIIa erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va umgesetzt, in der Y für ein Halogenatom steht. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt 10 werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise 15 von 80 bis 125°C.



Die Umsetzung von Va mit Aminen VI erfolgt unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen.

20 Verbindungen der Formel I in der X C₁-C₄-Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel VIII hergestellt werden. In Formel VIII bedeuten X" Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel IX umgesetzt und zu 25 Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].



Die Malonate VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)]

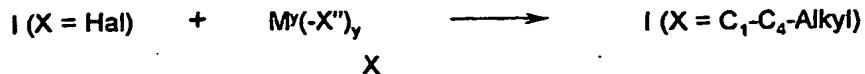
- 5 oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschließende Verseifung des Esters IX erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der
10 Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

15 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfosäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe
20 wie Methylchlorid, Chlorform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropyl-ether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht, können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit
30 metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



In Formel X steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X" für C₁-C₃-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1,

- 5 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen
 10 mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter verminderter Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch
 15 durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

- Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.
 20

- Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen
 25 können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

- Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten
 30 stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6
 35 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl,

1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

- 5 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl,
- 10 Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;
- 15 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-but enyl, 2-Methyl-1-but enyl, 3-Methyl-1-but enyl, 1-Methyl-2-but enyl, 2-Methyl-2-but enyl, 20 3-Methyl-2-but enyl, 1-Methyl-3-but enyl, 2-Methyl-3-but enyl, 3-Methyl-3-but enyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-but enyl, 1,1-Dimethyl-3-but enyl, 1,2-Dimethyl-1-but enyl, 1,2-Dimethyl-2-but enyl, 1,2-Dimethyl-3-but enyl, 1,3-Dimethyl-1-but enyl, 1,3-Dimethyl-2-but enyl, 1,3-Dimethyl-3-but enyl, 2,2-Dimethyl-3-but enyl, 2,3-Dimethyl-1-but enyl, 2,3-Dimethyl-2-but enyl, 2,3-Dimethyl-3-but enyl, 3,3-Dimethyl-1-but enyl, 3,3-Dimethyl-2-but enyl, 3,3-Dimethyl-3-but enyl, 1-Ethyl-1-but enyl, 1-Ethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-3-but enyl, 2-Ethyl-1-but enyl, 2-Ethyl-2-but enyl, 2-Ethyl-3-but enyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 35 Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

10

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclicus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 20 - 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Iothiazolidinyl, 4-Iothiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl,
- 25 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl,
- 30 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;

11

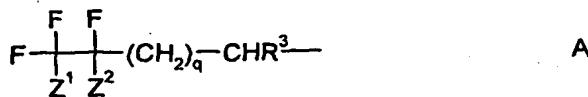
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und
- 5 2-Pyrazinyl;

- Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂,
- CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;
- 10 Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂,
- OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;
- 15 Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O,
- OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O;
- In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razeemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.
- 20 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Gruppen L der Formel I.

- Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

- Verbindungen der Formel I werden bevorzugt, in denen R¹ nicht Wasserstoff bedeutet.
- 30 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ für eine Gruppe A steht:



- 35 worin

- Z¹ Wasserstoff, Fluor oder C₁-C₆-Fluoroalkyl,
Z² Wasserstoff oder Fluor, oder

12

Z^1 und Z^2 bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

q 0 oder 1 ist; und

R³ Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

- 5 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl steht, welches durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² Wasserstoff bedeutet.

- 10 Gleichermassen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Methyl oder Ethyl steht.

Sofem R¹ und/oder R² Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R¹ oder R² sind die (R)-konfigurierten Isomeren bevorzugt.

- 15 Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morphinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinylring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

- 20 Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolering bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

- 25 30 Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R¹ CH(CH₃)-CH₂CH₃, CH(CH₃)-CH(CH₃)₂, CH(CH₃)-C(CH₃)₃, CH(CH₃)-CF₃, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CH₂, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R² Wasserstoff oder Methyl; oder R¹ und R² gemeinsam -(CH₂)₂CH(CH₃)(CH₂)₂, -(CH₂)₂CH(CF₃)(CH₂)₂ oder -(CH₂)₂O(CH₂)₂ bedeuten.

- 35 35 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy, wie Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy, besonders Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeuten.

Ein bevorzugter Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen I, in denen L¹ Chlor bedeutet.

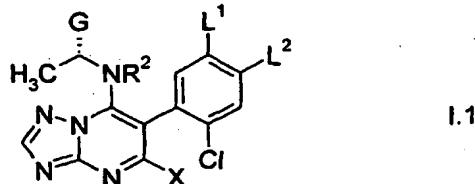
- 5 Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen I,
in denen L¹ Fluor bedeutet.

In einer anderen Ausgestaltung der vorliegenden Erfindung steht L¹ für Brom.

- 10 Ein besonders bevorzugter Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen
I, in denen L² Wasserstoff bedeutet.

In einer anderen Ausgestaltung der vorliegenden Erfindung steht L² für Methyl oder
Methoxy.

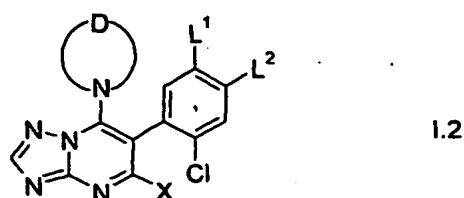
- 15 Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



in der

- G C₂-C₆-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und
C₁-C₄-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C₃-C₆-Cycloalkyl, insbe-
sondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
- 20 R² Wasserstoff oder Methyl;
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und
L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.
- 25 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in de-
nen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf-
oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist
und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten
und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl,
- 30 C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Hal-
ogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-
alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.2,

14



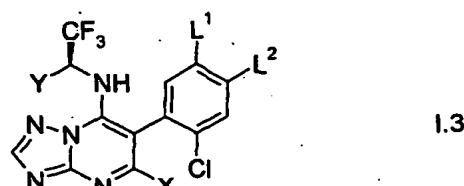
in der

D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann; und

5 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und
L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.

10

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.3.



15 in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.

Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Fluor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

20

Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Chlor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

25

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Chlor, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Chlor, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Chlor, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Chlor, L² Wasserstoff und die

15 Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Fluor, L² Wasserstoff und die Kombi-

20 nation von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Fluor, L² Wasserstoff und die Kombi-

nation von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Fluor, L² Wasserstoff und die Kombi-

nation von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Fluor, L² Wasserstoff und die Kombi-

nation von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Brom, L² Wasserstoff und die Kombi-

nation von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Brom, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Brom, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Brom, L² Wasserstoff und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Chlor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Chlor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Chlor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Chlor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Fluor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Fluor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Fluor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Fluor, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Brom, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 **Tabelle 22**

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Brom, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Brom, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Brom, L² Methyl und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Chlor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Chlor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle 27**

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Chlor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 28

35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Chlor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Fluor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Fluor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 31

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Fluor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 **Tabelle 32**

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Fluor, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 33

15 Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L¹ Brom, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 34

20 Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L¹ Brom, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L¹ Brom, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 36

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L¹ Brom, L² Methoxy und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 **Tabelle A**

Nr.	R ¹	R ²
A-1	H	H
A-2	CH ₃	H
A-3	CH ₃	CH ₃
A-4	CH ₂ CH ₃	H
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-6	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-7	CH ₂ CF ₃	H
A-8	CH ₂ CF ₃	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-9	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-10	CH ₂ CCl ₃	H
A-11	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-12	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-16	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-17	CH(CH ₃) ₂	H
A-18	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-19	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-20	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-21	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-22	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-24	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-25	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-27	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-28	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-35	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-36	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-42	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-45	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-48	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-51	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-54	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-57	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-60	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-63	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-66	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-69	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-72	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-75	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-78	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-81	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-82	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H

Nr.	R ¹	R ²
A-83	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₃
A-84	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-85	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	H
A-86	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-87	CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-88	CH ₂ C≡CH	H
A-89	CH ₂ C≡CH	CH ₃
A-90	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-91	Cyclopentyl	H
A-92	Cyclopentyl	CH ₃
A-93	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-94	Cyclohexyl	H
A-95	Cyclohexyl	CH ₃
A-96	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-97	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-98	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-99	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-100	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-102	-CH(CH ₃)CH ₂ -CH=CHCH ₂ -	
A-103	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-104	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-105	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-106	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-107	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-108	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-109	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-110	-(CH ₂) ₅ -	
A-111	-(CH ₂) ₄ -	
A-112	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-113	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-114	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-115	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-116	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-117	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-118	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-119	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	

Nr.	R ¹	R ²
A-120	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-121		-(CH ₂) ₆ -
A-122		-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -
A-123		-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -
A-124		-N=CH-CH=CH-
A-125		-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-
A-126		-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

5 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

10 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 15 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- 25 • *Pseudocercosporella herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 30 • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,

- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*
5 *ciliomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
10 wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
nach der Infektion der Materialien; Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-
schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

15 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis
20 1000 g/100 kg Saatgut, vorzugsweise 1 bis 200 g/100 kg, insbesondere 5 bis
100 g/100 kg verwendet.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Auf-
25 wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lö-
sungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die An-
wendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem
30 Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung ge-
währleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstreichen des
35 Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwen-
dung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kom-
men dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine
(z.B. Erdölfractionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalko-

hol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

- 5 - Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

- 10 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfosäure, Naphthalinsulfosäure, Phenolsulfosäure, Dibutylnaphthalinsulfosäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfosäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.
- 15 20

- Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

- 30 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 35 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Ge-

treidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nussschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

- Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

- Beispiele für Formulierungen sind:
1. Produkte zur Verdünnung in Wasser
 - 10 A Wasserlösliche Konzentrate (SL)
10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.
 - 15 B Dispergierbare Konzentrate (DC)
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.
 - 20 C Emulgierbare Konzentrate (EC)
15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
 - 25 D Emulsionen (EW; EO)
40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.
 - 35 E Suspensionen (SC, OD)
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.
 - 40 F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)
50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Disper-

gier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

5

G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirk-

10 stoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation

H Stäube (DP)

15 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

20 0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

J ULV- Lösungen (UL)

25 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

30 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

35 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,

Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

5

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

10 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, 15 Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

20 Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden 25 Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

30

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl;
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph;
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl;
- 35 • Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin;
- azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hextaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol,

- Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol;
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin;
 - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb;
 - 5 • Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenoxy, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiaben-10 dazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine;
 - Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat;
 - Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl;
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil;
 - 15 • Schwefel;
 - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Dicloomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid;
 - 20 • Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxytrobin;
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid;
 - Zirntsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.
- 25 Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer 30 Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: Herstellung von 2-Chlor-5-fluorphenylmalonsäurediethylester

- 35 Eine Suspension von Natriumhydrid (0,51 mol) in 140 ml 1,4-Dioxan wurde bei etwa 60°C während 2 Std. mit Malonsäurediethylester (0,49 mol) versetzt. Nach weiteren 10 min Rühren wurden 0,05 mol CuBr zugesetzt. Nach 15 min wurden 0,25 mol 2-Chlor-5-fluorbenzol in 10 ml Dioxan zugegeben. Die Reaktionsmischung wurde etwa 14 Std. bei 100 °C gehalten, dann bei etwa 15°C langsam mit 35 ml 12N Salzsäu-

re versetzt. Der Niederschlag wurde abfiltriert, das Filtrat mit Diethylether extrahiert. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es blieben 42 g der Titelverbindung zurück.

5 Beispiel 2: Herstellung von

5,7-Dihydroxy-6-(2-chlor-5-fluorphenylphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

Eine Mischung von 12 g 3-Amino-1,2,4-triazol, 0,17 mol des Esters aus Beispiel 1 und 50 ml Tributylamin wurde etwa sechs Std. bei 180°C gerührt. Bei etwa 70°C wurde eine 10 Lösung von 21 g NaOH in 200 ml Wasser zugegeben und die Mischung weiter 30 min gerührt. Die organische Phase wurde abgetrennt und die wässrige Phase mit Diethylether extrahiert. Aus der wässrigen Phase fiel nach Ansäuern mit konz. Salzsäure das Produkt aus. Durch Filtration wurden 33 g der Titelverbindung erhalten.

15 Beispiel 3: Herstellung von

5,7-Dichlor-6-(2-chlor-5-fluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

Eine Mischung von 30 g des Triazolopyrimidins aus Beispiel 2 und 50 ml POCl₃ wurde für acht Std. refluxiert, dabei destillierte etwas POCl₃ ab. Der Rückstand wurde in eine 20 CH₂Cl₂-Wasser-Mischung gegeben, die organische Phase abgetrennt, gewaschen und getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es wurden 27 g der Titelverbindung vom Fp. 137°C erhalten.

Beispiel 4: Herstellung von 5-Chlor-6-(2-chlor-5-fluorphenyl)-7-but-2-ylamino-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-3]

Eine Lösung von 1,5 mmol des Produkts aus Bsp. 3 in 10 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol 2-Butylamin, 1,5 mmol Triethylamin in 10 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 30 25°C gerührt, dann mit verd. Salzsäure gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel wurden 35 mg der Titelverbindung vom Fp. 171 erhalten.

Tabelle I – Verbindungen der Formel I

Nr.	R ¹	R ²	L ¹	L ²	X	Phys. Daten (Fp. [°C]; HPLC/MS [R _t ; m/z])
I-1	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	F	H	Cl	133
I-2	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		F	H	Cl	188
I-3	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	171

Nr.	R ¹	R ²	L ¹	L ²	X	Phys. Daten (Fp. [°C]); HPLC/MS [R _t ; m/z])
I-4	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	168
I-5	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H	F	H	Cl	168
I-6	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	111
I-7	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	109
I-8	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	F	H	Cl	109
I-9	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	178
I-10	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	173
I-11	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	H	Cl	173
I-12	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	155
I-13	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	157
I-14	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	H	Cl	157
I-15	CH ₂ CF ₃	H	F	H	Cl	175
I-16	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	F	OCH ₃	Cl		Harz
I-17	CH ₂ C(=CH ₂)-CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	OCH ₃	Cl	3,94 min; 410 (M+H) ⁺
I-18	(±) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	F	OCH ₃	Cl	3,91 min; 412 (M+H) ⁺
I-19	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	F	OCH ₃	Cl	3,71 min; 398 (M+H) ⁺
I-20	(±) CH(CH ₃)CH ₂ -CH ₃	H	F	OCH ₃	Cl	3,53 min; 384 (M+H) ⁺
I-21	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	F	OCH ₃	Cl		3,62 min; 396 (M+H) ⁺
I-22	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	F	OCH ₃	Cl		3,88 min; 410 (M+H) ⁺
I-23	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	F	OCH ₃	Cl		3,62 min; 396 (M+H) ⁺
I-24	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	F	OCH ₃	Cl	3,91 min; 412 (M+H) ⁺
I-25	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	F	OCH ₃	Cl	3,72 min; 398 (M+H) ⁺
I-26	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	OCH ₃	Cl	175-177
I-27	CH ₂ CF ₃	H	F	OCH ₃	Cl	191-193
I-28	CH ₂ CF ₃	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	3,50 min; 424 (M+H) ⁺
I-29	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	F	OCH ₃	Cl	108-110
I-30	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	128-130
I-31	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	Cl	H	Cl		186-187
I-32	(±) CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	H	Cl	H	Cl	157-158
I-33	(R)-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	Cl	H	Cl	187-188
I-34	(±)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	Cl	142-144
I-35	(R)-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	H	Cl	137-138
I-36	(±)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	Cl	109-110

Nr.	R ¹	R ²	L ¹	L ²	X	Phys. Daten (Fp. [°C]; HPLC/MS [R _t ; m/z])
I-37	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	H	Cl	106-107
I-38	(±)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	H	Cl	180-181
I-39	(S)-CH(CH ₃)-CF ₃	H	Cl	H	Cl	130-131
I-40	CH ₂ CF ₃	H	Cl	H	Cl	185-190

HPLC/MS:

HPLC-Säule: RP-18 (Chromolith Speed ROD, Fa. Merck KgaA, Deutschland); Eluent: Acetonitril + 0,1% Trifluoressigsäure (TFA)/Wasser + 0,1% TFA in Gradienten 5:95 -

5 95:5 (5 min) / 40°C.

MS: Quadrupol Elektrospray Ionisation, 80 V (positiv Modus)

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

10 Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netz-
15 mittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1: Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

20 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenauf-
schwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

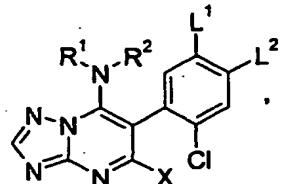
25 30 In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-3, I-13, I-15, I-23 bis I-35, I-38, bzw. I-39 behandelten Pflanzen maximal 20 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2: Kurative Wirksamkeit gegen Weizenbraunrost verursacht durch
Puccinia recondita

- 5 Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Kanzler" wurden mit einer Sporensuspension des Braunrostes (*Puccinia recondita*) inkuliert. Danach wurden die Töpfe für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22° C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Die infizierten Pflanzen wurden am nächsten Tag mit 10 einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Die Suspension oder Emulsion wurde wie oben beschrieben hergestellt. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 22° C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchte für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf 15 den Blättern ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-3, I-13, I-15, I-16, I-18 bis I-21, I-23 bis I-27, I-29, I-34 bis I-39, bzw. I-40 behandelten Pflanzen maximal 20 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 85 bis 90 % befallen waren.

20

Patentansprüche**1. Triazolopyrimidine der Formel I**

5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Halogencycloalkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₂-C₈-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

10 R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteraryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-Alkyliden und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann;

15 R¹ und/oder R² können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

20 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Halogenalkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkenyloxy, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

5 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

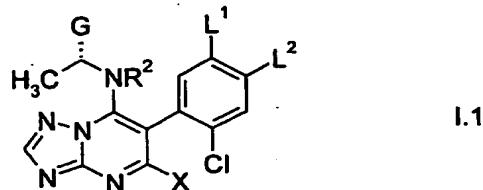
10 15 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

20 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

- 25 L¹ Fluor, Chlor oder Brom;
- 30 L² Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy; und
- 35 X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy.
- 40 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der L² Wasserstoff bedeutet.
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der L² Alkyl oder Alkoxy bedeutet.
4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der L¹ Fluor bedeutet.

5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der L¹ Chlor bedeutet.
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R¹ nicht Wasserstoff bedeutet.
- 5 7. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, in der X Chlor bedeutet.

10 8. Verbindungen der Formel I.1:



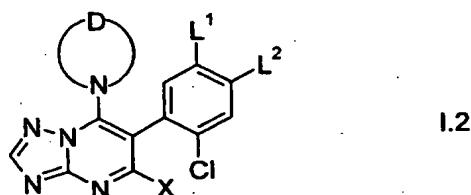
in der

G C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyethyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

R² Wasserstoff oder Methyl; und

15 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und L¹ und L² gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind.

9. Verbindungen der Formel I.2:

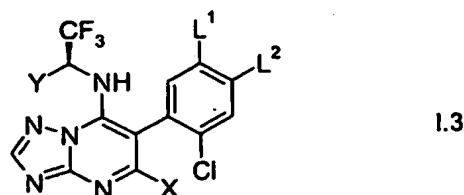


20 in der

D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann;

25 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten. und L¹ und L² gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind.

10. Verbindungen der Formel I.3:

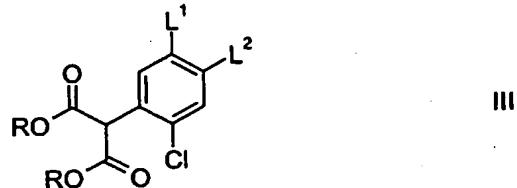


in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
 5 X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L¹ und L² gemäß ei-
 nem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind.

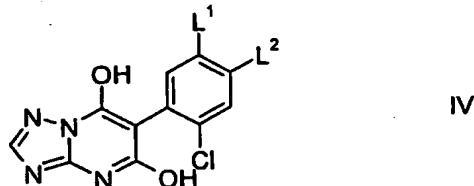
11. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der
 Ansprüche 1 bis 7, in der X für Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder
 10 C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



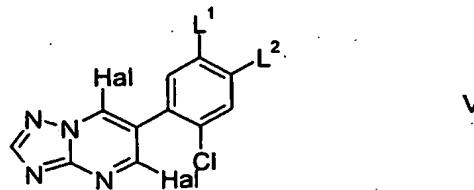
mit Phenymalonaten der Formel III



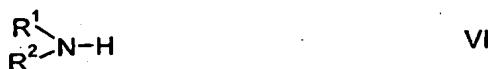
in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



15 Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,

5

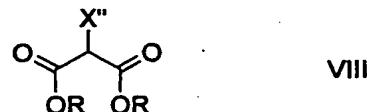
M-X'

VII

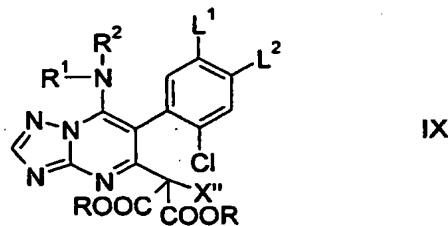
die je nach der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht,

10

mit Malonaten der Formel VIII,



in der X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX

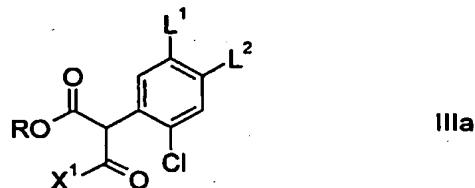


15

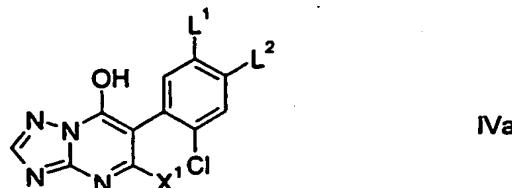
und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

12. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, in der X für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 11 mit Ketoestern der Formel:
- 20

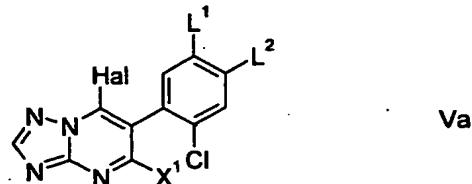
IIIa,



- 25
- in der X¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl und R für C₁-C₄-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel IVa



Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va



und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 11 zu
5 Verbindungen I.

13. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 11 und 12.
14. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbin-
10 dung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7.
15. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß einem
der Ansprüche 1 bis 3 pro 100 kg.
15. 16. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch ge-
kennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materi-
alien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer
Verbindung der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 7 behandelt.



EPA/EPO/0EB
D-80298 München

+49 89 2399-0
TX 523 656 epmu d
FAX +49 89 2399-4465

Europäisches
Patentamt

Generaldirektion 2

European
Patent Office

Directorate General 2

Office européen
des brevets

Direction Générale 2

BASF Aktiengesellschaft
Patente, Marken und Lizenzen
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE



Anmeldung Nr. 05 700 961.5 - 2117	Zeichen PF0000055279	Datum 08.02.2007
Anmelder BASF Aktiengesellschaft		

Mitteilung gemäß Regel 51(4) EPÜ

Hiermit wird Ihnen mitgeteilt, dass die Prüfungsabteilung beabsichtigt, ein europäisches Patent auf der Grundlage der oben genannten europäischen Patentanmeldung in der sich aus folgenden Unterlagen ergebenden Fassung zu erteilen:

In der Fassung für die Vertragsstaaten:

AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IS IT LI LT LU MC NL PL PT RO SE SI SK TR

Beschreibung, Seiten

1-32 ursprüngliche Fassung

Ansprüche, Nr.

1-16 ursprüngliche Fassung

In der Anlage erhalten Sie eine Kopie der oben genannten Unterlagen.

Die Bezeichnung der Erfindung in den drei Amtssprachen des Europäischen Patentamts, die Internationale Patentklassifikation, die benannten Vertragsstaaten, der registrierte Name des Annehmers und die bibliografischen Daten sind der Anlage (EPA Form 2056) zu entnehmen.

Sie werden aufgefordert, innerhalb einer **nicht verlängerbaren** Frist von vier Monaten, gerechnet von der Zustellung dieser Mitteilung an,

1. die Übersetzung des Patentanspruchs/der Patentansprüche in einfacher Ausfertigung in den beiden anderen Amtssprachen des Europäischen Patentamts einzureichen;

EUR

- 2a. die Erteilungsgebühr einschließlich der Druckkostengebühr bis höchstens 35



Seiten zu entrichten:

Kennziffer 007 750.00

2b.	die Druckkostengebühr für die 36. Seite und jede weitere Seite zu entrichten; Anzahl der Seiten: 3	Kennziffer 008	33.00
3.	die Anspruchsgebühr(en) zu entrichten (Regel 51(7) EPÜ); Zahl der zu entrichtenden Anspruchsgebühren:	Kennziffer 016	0.00
Gesamtbetrag			783.00

Zur Möglichkeit eines Antrags auf beschleunigte Erteilung gemäß Artikel 97(6)EPÜ siehe ABI. EPA 2001, 459.

Sollten Sie Ihr Einverständnis mit der zur Erteilung vorgesehenen Fassung nicht geben, und möchten Änderungen oder Korrekturen beantragen, so ist die in der Regel 51(5) EPÜ beschriebene Vorgehensweise zu befolgen.

Wenn diese Mitteilung auf Grund eines Hilfsantrages erstellt wurde, und Sie innerhalb der gesetzten Frist erwidern, dass Sie den Hauptantrag oder einen höherrangigen, nicht zulässigen Antrag aufrechterhalten, wird die Anmeldung zurückgewiesen (Artikel 97(1) EPÜ, siehe auch Rechtauskunft 15/05 (rev. 2), ABI 6/2005, 357).

Wenn die beigefügten Ansprüche von der Prüfungsabteilung vorgeschlagene Änderungen enthalten, und Sie innerhalb der gesetzten Frist erwidern, dass Sie diesen Änderungen nicht zustimmen können, so wird die Anmeldung unter Artikel 97(1) EPÜ zurückgewiesen, falls keine Übereinstimmung über die zur Erteilung vorgeschlagene Fassung erzielt werden kann.

Mit Ausnahme der in den beiden obigen Paragraphen genannten Fällen gilt die Europäische Patentanmeldung in allen Fällen als zurückgenommen, wenn die Erteilungsgebühr und die Druckkostengebühr oder die Anspruchsgebühren nicht rechtzeitig entrichtet oder die Übersetzungen nicht rechtzeitig eingereicht werden (Regel 51(8) EPÜ).

Bei allen Zahlungsarten wird gebeten, EPA Form 1010 zu benutzen oder die Kennziffer(n) der Gebühr(en) anzugeben.

Nach ihrer Veröffentlichung kann die europäische Patentschrift gebührenfrei vom Veröffentlichungsserver des EPA über <https://publications.european-patent-office.org> heruntergeladen oder gegen Zahlung einer Gebühr ausschließlich von der Dienststelle Wien bezogen werden (ABI. EPA 2005, 126).

Auf schriftlichen Antrag erhält jeder Patentinhaber die Urkunde über das europäische Patent zusammen mit einer Kopie der Patentschrift, wenn der Antrag innerhalb der Frist nach Regel 51 (4) EPÜ eingereicht wird. Wurde dieser Antrag schon früher gestellt, so ist er innerhalb der Frist nach Regel 51 (4) EPÜ zu bestätigen. Die beantragte Kopie wird gebührenfrei ausgestellt. Wird der Antrag nach Ablauf der Frist nach Regel 51 (4) EPÜ eingereicht, so wird die Urkunde ohne eine Kopie der Patentschrift ausgestellt.

Übersetzung des Prioritätsbelegs/der Prioritätsbelege

Ist die nach Artikel 88(1) EPÜ erforderliche Übersetzung des Prioritätsbelegs oder die Erklärung gemäß Regel 38(5) EPÜ noch nicht eingereicht, wird Form 2530 getrennt übersandt. Die Übersetzung ist bis zum Ablauf der oben genannten Frist einzureichen (Regel 38(5) EPÜ).

Hinweis auf die Entrichtung der Jahresgebühren



Wird eine Jahresgebühr nach Zustellung dieser Aufforderung und vor dem vorgesehenen Tag der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents fällig (Regel 37(1) EPÜ), so wird der Hinweis erst bekanntgemacht, wenn die Jahresgebühr und gegebenenfalls die Zuschlagsgebühr entrichtet ist (Regel 51(9) EPÜ).

Jahresgebühren sind nach Artikel 86(4) EPÜ bis zu dem Jahr fällig und an das Europäische Patentamt zu entrichten, in dem der Hinweis auf die Erteilung des europäischen Patents bekanntgemacht wird.

Einreichung von Übersetzungen in den Vertragsstaaten

Folgende Vertragsstaaten verlangen gemäß Artikel 65(1) EPÜ eine Übersetzung der europäischen Patentschrift in ihre/eine ihrer Amtssprachen (Regel 51(10) EPÜ), sofern diese Patentschrift nicht in ihrer/einer ihrer Amtssprachen veröffentlicht wird

- innerhalb von **drei** Monaten nach Bekanntmachung des vorgenannten Hinweises auf die Erteilung:

AT	ÖSTERREICH	GR	GRIECHENLAND
BE	BELGIEN	HU	UNGARN
BG	BULGARIEN	IS	ISLAND
CH	SCHWEIZ / LIECHTENSTEIN	IT	ITALIEN
CY	ZYPERN	LT	LITAUEN
CZ	TSCHECHISCHE REPUBLIK	NL	NIEDERLANDE
DE	DEUTSCHLAND	PL	POLEN
DK	DÄNEMARK	PT	PORTUGAL
EE	ESTLAND	RO	RUMÄNIEN
ES	SPANIEN	SE	SCHWEDEN
FI	FINNLAND	SI	SLOWENIEN
FR	FRANKREICH	SK	SLOWAKEI
GB	VEREINIGTES KÖNIGREICH	TR	TÜRKEI

- innerhalb von **sechs** Monaten nach Bekanntmachung des vorgenannten Hinweises auf die Erteilung:

IE IRLAND

Der Tag der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des Europäischen Patents im Europäischen Patentblatt wird aus dem Erteilungsbeschluss (EPA Form 2006) zu ersehen sein.

Im Falle einer wirksamen Erstreckung verlangen folgende Erstreckungsstaaten innerhalb von **drei** Monaten nach Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des Europäischen Patents eine Übersetzung der **Patentansprüche** in ihre Amtssprache:

AL	ALBANIEN	LV	LETTLAND
BA	BOSNIEN-HERZEGOVINA	MK	MAZEDONIEN
HR	KROATIEN *	YU	SERBIEN UND
MONTENEGRÖ			

* verlangt die Übersetzung der Patentschrift

Die Einreichung der Übersetzung an die nationalen Ämter der Vertrags- oder Erstreckungsstaaten hat gemäß den hierfür im jeweiligen Staat geltenden Vorschriften zu erfolgen. Nähere Einzelheiten (z.B. Bestellung eines Inlandsvertreters oder Nennung einer inländischen Zustellanschrift) können der Informationsbroschüre "Nationales Recht zum EPÜ" und den ergänzenden Informationen im Amtsblatt des EPA oder der Internetseite des EPA entnommen werden.



Datum 08.02.2007

Blatt 4

Anmeldenummer: 05 700 961.5

Wird die bei den Vertragsstaaten und bei den Erstreckungsstaaten einzureichende Übersetzung nicht fristgerecht und vorschriftsmäßig eingereicht, kann dies zur Folge haben, dass die Wirkung des Patents in dem betreffenden Staat als von Anfang an nicht eingetreten gilt.

Hinweis für die Teilnehmer am automatischen Abbuchungsverfahren

Die Gebühr wird /die Gebühren werden am letzten Tag der Zahlungsfrist automatisch abgebucht, falls dem EPA nicht bis zu diesem Zeitpunkt eine gegenteilige Erklärung zugegangen ist. Näheres siehe Vorschriften über das automatische Abbuchungsverfahren (vgl. Beilage zum ABI. EPA 2/2002).

Prüfungsabteilung:

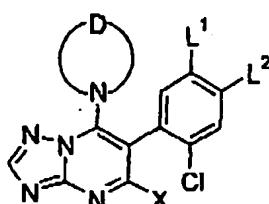
Vorsitzender: Herz, Claus
2. Prüfer: Wolf, Claudia
1. Prüfer: Rudolf, Manfred



Ullrich, Josef
Für die Prüfungsabteilung
Tel. Nr.: +49 89 2399 - 8048

Anlage(n): Form 2056
38 Kopien der Unterlagen

14



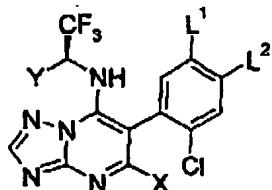
I.2

in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclil oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann; und
- 5 X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und
- L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und
- L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.

10

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.3.



I.3

- 15 in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.

Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Fluor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

20

Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Chlor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

- ~~insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem einzeln betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.~~

Nr.	R ¹	R ²
A-120	- $(CH_2)_2-CHOH-(CH_2)_2-$	
A-121		- $(CH_2)_6-$
A-122	- $CH(CH_3)-(CH_2)_5-$	
A-123	- $(CH_2)_2-N(CH_3)-(CH_2)_2-$	
A-124	- $N=CH-CH=CH-$	
A-125	- $N=C(CH_3)-CH=C(CH_3)-$	
A-126	- $N=C(CF_3)-CH=C(CF_3)-$	

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basiomyzeten*.

- 5 Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 15 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
 - *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
 - *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
 - *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
 - *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
 - *Plasmopara viticola* an Reben,
 - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- 25 • *Pseudocercosporella herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
 - *Puccinia*-Arten an Getreide,
 - *Pyricularia oryzae* an Reis,
 - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 30 • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,



The Chemical Company

Global Intellectual Property

BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen, Deutschland

2.3.2007

Europäisches Patentamt
80298 München

GVX/P – C 6
Dr. Matthias Niedenbrück
Tel.: +49 621 60-43880
Fax.: +49 621 60-48821

Europäische Anmeldung Nr. 06 700 961.5 - 2117
Unser Zeichen: PF 55279/SSp
Mitteilung gemäß R. 51 (4) EPÜ vom: 8.2.2007

Hiermit erklären wir unser Einverständnis mit der vom Europäischen Patentamt gemäß Mitteilung nach Regel 51 (4) EPÜ für die Patenterteilung in Aussicht genommenen Fassung der oben genannten Anmeldung.

Zur Verringerung der Druckkosten bitten wir die Seiten 14 und 22, wie aus der beiliegenden Vorlage ersichtlich, amtsseitig zu kürzen und die Seiten 15 bis 21 amtseitig ganz zu streichen.

Diese Streichungen stellen keinen Verzicht dar, sie dienen lediglich zur Verringerung der Druckkosten.

BASF Aktiengesellschaft

I.V. Niedenbrück
AV-Nr. 3224

Anlagen: Seiten 14 und 22 mit handschriftlichen Änderungen

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen, Deutschland
Telefon +49 621 60-0
Telefax +49 621 60-42525
E-Mail Info.service@basi-ag.de
Internet www.basi.de

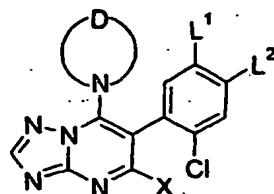
Sitz der Gesellschaft: 67056 Ludwigshafen
Registergericht: Amtsgericht Ludwigshafen
Eintragungsnummer: HRB 3000

Bankverbindung:
Wintershall Bank GmbH, 34119 Kassel
Kontonr. 400506, BLZ 520 200 00
IBAN DE57 5202 0000 0000 4005 05
SWIFT BIC WINBDE52XXX

Aufsichtsratsvorsitzender: Jürgen Strube

Vorstand: Jürgen Hambrecht, Vorsitzender;
Egbert Voscherau, stellv. Vorsitzender;
Kurt Bock, John Feldmann, Andreas Kreitmeyer,
Klaus Peter Löbbe, Stefan Marchowski, Peter Oakley

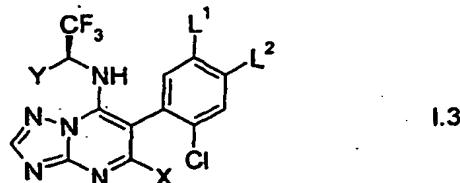
14



in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclen oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und C₁-C₂-Halogenalkyl tragen kann; und
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten und L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.
- 10

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.3.



- in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L¹ und L² die Bedeutung gemäß Formel I aufweisen.

Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Fluor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

20 Eine weitere bevorzugte Ausgestaltung der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen L¹ Chlor und L² Alkyl oder Alkoxy, insbesondere Methyl oder Methoxy bedeuten.

~~insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.~~

Nr.	R ¹	R ²
A-120	$-(CH_2)_2-CHOH-(CH_2)_2-$	
A-121		$-(CH_2)_5-$
A-122		$-CH(CH_3)-(CH_2)_5-$
A-123		$-(CH_2)_2-N(SH_2)-(CH_2)_2-$
A-124		$-N=CH-CH=CH-$
A-125		$-N=C(CH_3)-CH=C(CH_3)-$
A-126		$N=C(CF_3)-CH=C(CF_3)-$

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine her-vorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Ba-*

- 5 *sidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an ver-schiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Ba-nanen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemü-sepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 15 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
 - *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
 - *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
 - *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
 - *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
 - *Plasmopara viticola* an Reben,
 - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- 25 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
 - *Puccinia*-Arten an Getreide,
 - *Pyricularia oryzae* an Reis,
 - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 30 • *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,



The Chemical Company

Global Intellectual Property

BASF Aktiengesellschaft, 67058 Ludwigshafen, Deutschland

Bereits per Telefax gesendet!

2.3.2007

Europäisches Patentamt
80298 München

EPO - Munich
54

06. März 2007

GVX/P – C 6
Dr. Matthias Niedenbrück
Tel.: +49 621 60-43880
Fax.: +49 621 60-48821

Europäische Anmeldung Nr. 05 700 961.5 - 2117
Unser Zeichen: PF 55279/SSp
Mitteilung gemäß R. 51 (4) EPÜ vom: 8.2.2007

Hiermit erklären wir unser Einverständnis mit der vom Europäischen Patentamt gemäß Mitteilung nach Regel 51 (4) EPÜ für die Patenterteilung in Aussicht genommenen Fassung der oben genannten Anmeldung.

Zur Verringerung der Druckkosten bitten wir die Seiten 14 und 22, wie aus der beiliegenden Vorlage ersichtlich, amtsseitig zu kürzen und die Seiten 15 bis 21 amtsseitig ganz zu streichen.

Diese Streichungen stellen keinen Verzicht dar, sie dienen lediglich zur Verringerung der Druckkosten.

BASF Aktiengesellschaft

i.V. Niedenbrück

i.V. Niedenbrück
AV-Nr. 3224

Anlagen: Seiten 14 und 22 mit handschriftlichen Änderungen

BASF Aktiengesellschaft
67058 Ludwigshafen, Deutschland
Telefon +49 621 60-0
Telefax +49 621 60-42525
E-Mail info.service@basf-ag.de
Internet www.bASF.de

Sitz der Gesellschaft: 67058 Ludwigshafen
Registergericht: Amtsgericht Ludwigshafen
Eintragungsnummer: HRB 3000

Bankverbindung:
Wintershall Bank GmbH, 34119 Kassel
Kontonr. 400505, BLZ 520 200 00
IBAN DE87 5202 0000 0000 4005 05
SWIFT BIC WINBDE52XXX

Aufsichtsratsvorsitzender: Jürgen Strübe

Vorstand: Jürgen Hambrecht, Vorsitzender;
Egbert Voscherau, stellv. Vorsitzender;
Kurt Bock, John Feldmann, Andreas Krelmeyer,
Klaus Peter Löbbecke, Stefan Marcinowski, Peter Oakley



Europäisches Patentamt
80298 MÜNCHEN
DEUTSCHLAND
Tel.: +49 89 2399 - 0
Fax: +49 89 2399 - 4465

Europäisches
Patentamt

European
Patent Office

Office européen
des brevets

BASF Aktiengesellschaft
Patente, Marken und Lizenzen
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE



Formalsachbearbeiter

Name: Ullrich

Tel.: 8048

Datum
22-03-2007

Zeichen PF0000055279	Anmeldung Nr./Patent Nr. 05700961.5 - 2117
Anmelder/Patentinhaber BASF Aktiengesellschaft	

KURZMITTEILUNG

Betreff:

- Ihr Schreiben vom
 Unser Telefongespräch vom
 Mitteilung nach Regel 51 (4) EPÜ vom 08.02.07
 Ihr Antrag auf Änderung/Berichtigung von Unterlagen,
eingegangen am 05-03-2007

Die nach Regel 51 (5) EPÜ geforderten Übersetzungen der (geänderten/berichtigten) Patentansprüche wurden nicht eingereicht und/oder die Zahlung der Gebühren ist nicht erfolgt.

Der vorliegende Fall stellt keine der in den Richtlinien C-VI, 15.4a genannten Ausnahmen dar. Sie werden daran erinnert, dass innerhalb der Frist nach Regel 51 (4) EPÜ die Übersetzungen der (geänderten/berichtigten) Patentansprüche einzureichen sind und/oder die Zahlung der fälligen Gebühren erfolgen muss.

Bei nicht fristgerechter Zahlung der Erstellungs- und Druckkostengebühren oder nicht fristgerechter Einreichung der Übersetzungen der Patentansprüche gilt die Anmeldung als zurückgenommen (Regel 51 (8) EPÜ).

Für die Prüfungsabteilung





Europäisches
Patentamt

European
Patent Office

Office européen
des brevets

Empfangsbescheinigung

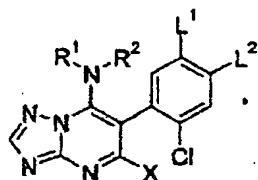
Hiermit wird bestätigt, daß folgende nachgereichte Unterlagen bei uns eingegangen sind:

Eingangsnummer	233817		
Anmeldenummer	EP05700961.5		
Tag des Eingangs	22 Mai 2007		
Anmeldeamt	Europäisches Patentamt, Den Haag		
Ihr Zeichen	PF 55279		
Anmelder	BASF Aktiengesellschaft		
Anzahl der Anmelder	1		
Eingereichte Dokumente	package-data.xml ep-sfd-request.xml CLMSTRAN-2.pdf\55279 fr.pdf (8 p.)	epf1038.pdf (2 p.) CLMSTRAN-1.pdf\55279 en.pdf (6 p.)	
Eingereicht von	CN=C. Reininger;2738,O=BASF AG,C=DE		
Art der Einreichung	Online		
Zeitpunkt des Eingangs	22. Mai 2007, 07:32:44 Uhr		
Komprimat	83:B4:C8:15:01:82:28:56:B5:B9:3F:26:DA:31:87:F7:23:1A:6F:71		

/Europäisches Patentamt/

R E V E N D I C A T I O N S

1. Triazolopyrimidines de la formule I :



5 dans laquelle les substituants ont la
signification suivante :

10 R¹, R² représentent indépendamment l'un de l'autre
de l'hydrogène ou un groupe alkyle en C₁-C₈,
halogénoalkyle en C₁-C₈, cycloalkyle en C₃-C₈,
halogénocycloalkyle en C₃-C₈, alcényle en C₂-
C₈, halogénoalcényle en C₂-C₈, cycloalcényle
en C₃-C₆, halogénocycloalcényle en C₃-C₆,
alcyne en C₂-C₈, halogénoalcyne en C₂-C₈ ou
phényle, naphtyle, ou un hétérocycle
15 pentagonal ou hexagonal saturé, partiellement
insaturé ou aromatique, contenant un à quatre
hétéroatomes du groupe O, N ou S,

20 R¹ et R² pouvant aussi former conjointement avec
l'atome d'azote, sur lequel ils sont fixés,
un hétéroaryle où hétérocyclyle pentagonal ou
hexagonal, qui est fixé par l'intermédiaire
du N et peut contenir un à trois autres
hétéroatomes du groupe O, N et S, comme
chaînon du cycle, et/ou porter un ou
plusieurs substituants du groupe halogène,
alkyle en C₁-C₆, halogénoalkyle en C₁-C₆,

alcényle en C₂-C₆, halogénoalcényle en C₂-C₆,
alcoxy en C₁-C₆, halogénoalcoxy en C₁-C₆,
alcényloxy en C₃-C₆, halogénoalcényloxy en C₃-
C₆, (exo)-alkylène en C₁-C₆ et oxy-alkylèneoxy
en C₁-C₃,

5 R¹ et/ou R² pouvant porter un à quatre groupes
R^a identiques ou différents :

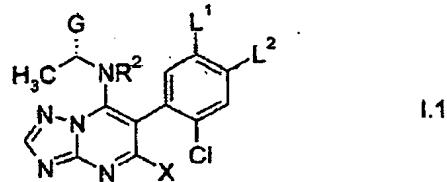
R^a représentant un halogène ou un groupe cyano,
nitro, hydroxy, alkyle en C₁-C₆,
10 halogénoalkyle en C₁-C₆, alkylcarbonyle
en C₁-C₆, cycloalkyle en C₃-C₆, alcoxy en
C₁-C₆, halogénoalcoxy en C₁-C₆,
alcoxycarbonyle en C₁-C₆, alkylthio en
C₁-C₆, alkylamino en C₁-C₆, di-C₁-C₆-
15 alkylamino, alcényle en C₂-C₈, halogéno-
alcényle en C₂-C₈, cycloalcényle en C₃-C₈,
alcényloxy en C₂-C₆, halogénoalcényloxy
en C₃-C₆, alcynyle en C₂-C₆,
halogénoalcynyle en C₂-C₆, alcynyloxy en
20 C₃-C₆, halogénoalcynyloxy en C₃-C₆,
cycloalcoxy en C₃-C₆, cycloalcényloxy en
C₃-C₆, oxy-alkylèneoxy en C₁-C₃, phényle,
naphtyle, un hétérocycle pentagonal à
hexagonal saturé, partiellement insaturé
25 ou aromatique, contenant un à quatre
hétéroatomes du groupe O, N ou S,
ces groupes aliphatiques, alicycliques ou
aromatiques pouvant à leur tour être
partiellement ou totalement halogénés ou
30 porter un à trois groupes R^b,

R^b représentant un halogène ou un groupe cyano,
nitro, hydroxy, mercapto, amino,
carboxyle, aminocarbonyle,
aminothiocarbonyle, alkyle,
35 halogénoalkyle, alcényle,
alcényloxy, alcynyloxy, alcoxy,
halogénoalcoxy, alkylthio, alkyl-
amino, dialkylamino, formyle,
alkylcarbonyle, alkylsulfonyle,

alkylsulfoxyde, alcooxycarbonyle,
alkylcarbonyloxy,
alkylaminocarbonyle, dialkylamino-
carbonyle, alkylaminothiocarbonyle,
dialkylaminothiocarbonyle, les
groupes alkyle dans ces radicaux
contenant 1 à 6 atomes de carbone
et les groupes alcényle ou alcynyle
cités contenant dans ces radicaux 2
à 8 atomes de carbone,
et/ou un à trois des radicaux
suivants :
cycloalkyle, cycloalcoxy,
hétérocyclyle, hétérocycloloxy, les
systèmes cycliques contenant 3 à
10 chaînons, aryle, aryloxy,
arylthio, aryl-C₁-C₆-alcoxy, aryl-
C₁-C₆-alkyle, hétaryle, hétaryloxy,
hétarylthio, les radicaux aryle
contenant de préférence 6 à
10 chaînons, les radicaux hétaryle
5 ou 6 chaînons, les systèmes
cycliques pouvant être
partiellement ou totalement
halogénés ou substitués par des
groupes alkyle ou halogénoalkyle,
L¹ représente du fluor, du chlore ou du brome,
L² représente de l'hydrogène ou un groupe alkyle
en C₁-C₄ ou alcoxy en C₁-C₄, et
X représente de l'halogène ou un groupe cyano,
alkyle en C₁-C₄, halogénoalkyle en C₁-C₄, alcoxy
en C₁-C₄ ou halogénoalcoxy en C₁-C₂.
2. Composés de la formule I suivant la
revendication 1, dans laquelle L² représente de
l'hydrogène.
3. Composés de la formule I suivant la
revendication 1, dans laquelle L² représente un
groupe alkyle ou alcoxy.
4. Composés de la formule I suivant l'une des

revendications 1 à 3, dans laquelle L¹ représente du fluor.

5. Composés de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 3, dans laquelle L¹ représente du chlore.
6. Composés de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 5, dans laquelle R¹ ne représente pas de l'hydrogène.
7. Composés de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 6, dans laquelle X représente du chlore.
- 10 8. Composés de la formule générale I.1 :

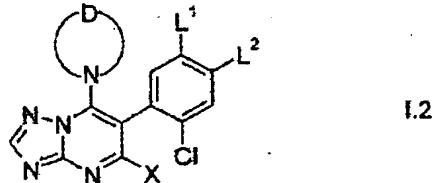


I.1

dans laquelle

- 15 G représente un groupe alkyle en C₂-C₆, C₁-C₄-alcooxyméthyle ou cycloalkyle en C₃-C₆, R² représente de l'hydrogène ou du méthyle, et X représente du chlorure, du méthyle, du cyano, du méthoxy ou de l'éthoxy, et
- 20 L¹ et L² sont définis conformément à une des revendications 1 à 5.

9. Composés de la formule I.2 :



I.2

dans laquelle

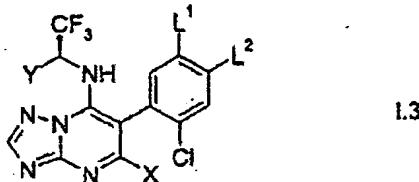
- 25 D forme, conjointement à l'atome d'azote, un groupe hétéroaryle ou hétérocyclique pentagonal ou hexagonal, qui est fixé par l'intermédiaire du N et peut contenir un autre hétéroatome du groupe O, N et S comme chaînon du cycle et/ou porter un ou plusieurs substituants du groupe halogène, alkyle en
- 30

C_1-C_4 , alcoxy en C_1-C_4 et halogénoalkyle en C_1-C_2 ,

X représente du chlore, du méthyle, du cyano, du méthoxy ou de l'éthoxy,

5 et L¹ et L² sont définis conformément à une des revendications 1 à 5.

10. Composés de la formule I.3 :



10 dans laquelle Y représente de l'hydrogène ou un groupe alkyle en C_1-C_4 ,

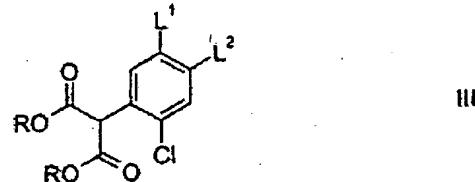
X représente du chlore, du méthyle, du cyano, du méthoxy ou de l'éthoxy, et

L¹ et L² sont définis conformément à l'une des revendications 1 à 5.

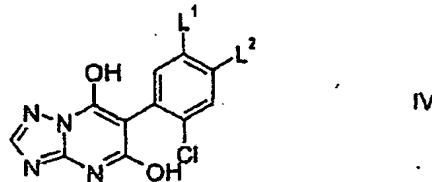
15 11. Procédé de préparation des composés de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 7, dans laquelle X représente de l'halogène ou un groupe cyano, alkyle en C_1-C_4 , alcoxy en C_1-C_4 ou halogénoalcoxy en C_1-C_2 , par réaction de 5-aminotriazole de la formule II :



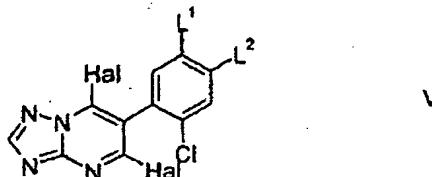
avec des phénylmalonates de la formule III :



25 dans laquelle R représente un groupe alkyle, ce qui donne des dihydroxytriazolopyrimidines de la formule IV :



halogénéation en les composés dihalogénés de la formule V :



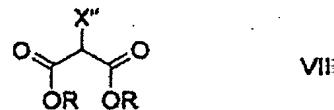
5 et réaction de V avec des amines de la formule VI :



pour former des composés de la formule I, dans laquelle X représente de l'halogène, éventuellement pour la préparation de composés I, dans lesquels X représente un groupe cyano, alcoxy en C₁-C₄ ou halogénoalcoxy en C₁-C₂, par réaction de composés I, dans lesquels X représente de l'halogène, avec des composés de la formule VII :

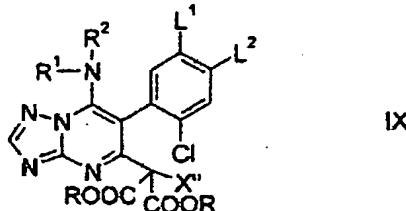


qui, selon le groupe X' à introduire, représentent un cyanure inorganique, un alcoolate ou un alcoolate halogéné et dans lesquels M représente un cation ammonium, tétraalkylammonium, alcalin ou alcalino-terreux et éventuellement, pour la préparation de composés de la formule I selon la revendication 1 dans lesquels X représente un groupe alkyle, par réaction des composés I, dans lesquels X représente de l'halogène, avec des malonates de la formule VIII :



dans laquelle X'' représente de l'hydrogène ou un groupe alkyle en C₁-C₃ et R représente un groupe

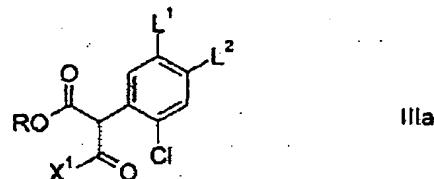
alkyle en C₁-C₄, pour former des composés de la formule IX :



IX

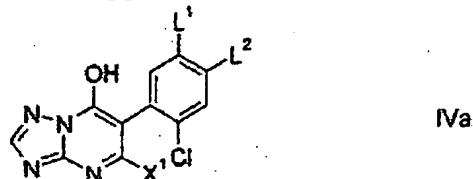
et décarboxylation en composés I, dans lesquels X
représente un groupe alkyle.

- 5 12. Procédé de préparation des composés de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 6, dans laquelle X représente un groupe alkyle en C₁-C₄ ou halogénoalkyle en C₁-C₄, par réaction de
10 5-aminotriazole de la formule II suivant la revendication 11 avec des cétoesters de la formule IIIa :



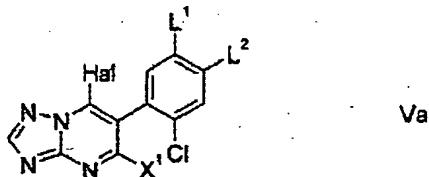
IIIa

- 15 dans laquelle X¹ représente un groupe alkyle en C₁-C₄ ou halogénoalkyle en C₁-C₄ et R un groupe alkyle en C₁-C₄, pour former des 5-alkyl-7-hydroxy-6-phényltriazolopyrimidines de la formule IVa :



IVa

- halogénéation de IVa en
20 7-halogénotriazolopyrimidines de la formule Va :



Va

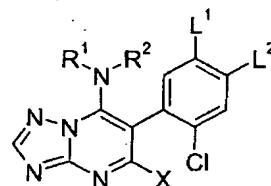
et réaction de Va avec des amines de la formule VI suivant la revendication 11, pour former des

composés I.

13. Composés des formules IV, IVa, V et Va suivant les revendications 11 et 12.
- 5 14. Produits fongicides, contenant un support solide ou liquide et un composé de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 7.
15. Semences, contenant 1 à 1000 g d'un composé de la formule I suivant l'une des revendications 1 à 3, par 100 kg.
- 10 16. Procédé de lutte contre des champignons nuisibles phytopathogènes, caractérisé en ce qu'on traite les champignons ou les matériels, plantes, sols ou semences à protéger d'une infestation par des champignons avec une quantité efficace d'un composé de la formule I suivant les revendications 1 à 7.
- 15

Claims

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

R¹, R² independently of one another are hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₂-C₈-alkenyl,

C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl,

10 C₂-C₈-alkynyl, C₂-C₈-haloalkynyl or phenyl, naphthyl, or a 5- or 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

15 R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are attached may also form a 5- or 6-membered heterocycl or heteroaryl which is attached via N and may contain 1 to 3 further heteroatoms from the group consisting of O, N and S as ring members and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₃-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-alkylene and oxy-C₁,C₃-alkyleneoxy;

20 R¹ and/or R² may carry one to four identical or different groups R^a:

25 R^a is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁,C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylamino, di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-haloalkenyl, C₃-C₈-cycloalkenyl, C₂,C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-haloalkenyloxy,

5 C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-alkynyoxy; C₃-C₆-haloalkynyoxy, C₃-C₆-cycloalkoxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, oxy-C₁-C₃-alkyleneoxy, phenyl, naphthyl, a 5- to 10-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle which contains one to four heteroatoms from the group consisting of O, N and S,

10 where these aliphatic, alicyclic or aromatic groups for their part may be partially or fully halogenated or may carry one to three groups R^b:

10 R^b is halogen, cyano, nitro, hydroxyl, mercapto, amino, carboxyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, alkyl, haloalkyl, alkenyl, alkenyloxy, alkynyoxy, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, alkylamino, dialkylamino, formyl, alkylcarbonyl, alkylsulfonyl, alkylsulfoxyl, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, where the alkyl groups in these radicals contain 1 to 6 carbon atoms and the alkenyl or alkynyl groups mentioned in these radicals contain 2 to 8 carbon atoms;

and/or one to three of the following radicals:

25 cycloalkyl, cycloalkoxy, heterocyclyl, heterocyclyloxy, where the cyclic systems contain 3 to 10 ring members; aryl, aryloxy, arylthio, aryl-C₁-C₆-alkoxy, aryl-C₁-C₆-alkyl, hetaryl, hetaryloxy, hetarylthio, where the aryl radicals preferably contain 6 to 10 ring members and the hetaryl radicals 5 or 6 ring members, where the cyclic systems may be partially or fully halogenated or substituted by alkyl or haloalkyl groups;

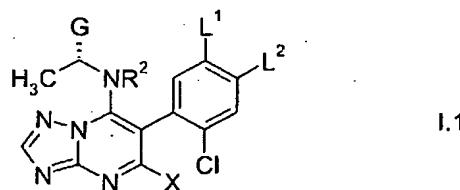
30 L¹ is fluorine, chlorine or bromine;

35 L² is hydrogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-alkoxy; and

X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₂-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy.

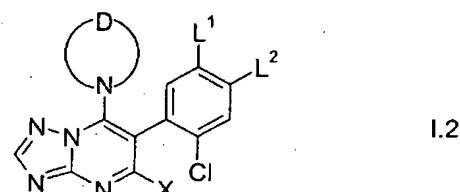
2. The compound of the formula I according to claim 1 in which L² is hydrogen.
- 40 3. The compound of the formula I according to claim 1 in which L² is alkyl or alkoxy.

4. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 3 in which L¹ is fluorine.
5. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 3 in which L¹ is chlorine.
6. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 5 in which R¹ is not hydrogen.
- 10 7. The compound of the formula I according to any of claims 1 to 6 in which X is chlorine.
8. A compound of the formula I.1:



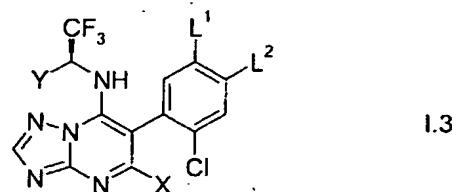
15 in which
 G is C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkoxymethyl or C₃-C₆-cycloalkyl;
 R² is hydrogen or methyl; and
 X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy
 and L¹ and L² are as defined in any of claims 1 to 5.

- 20 9. A compound of the formula I.2:



in which
 D together with the nitrogen atom forms a 5- or 6-membered heterocycll or heteroaryl which is attached via N and may contain a further heteroatom from the group consisting of O, N and S as ring member and/or may carry one or more substituents from the group consisting of halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy and C₁-C₂-haloalkyl;
 X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy.
 30 and L¹ and L² are as defined in one of claims 1 to 5.

10. A compound of the formula I.3:



in which Y is hydrogen or C₁-C₄-alkyl;

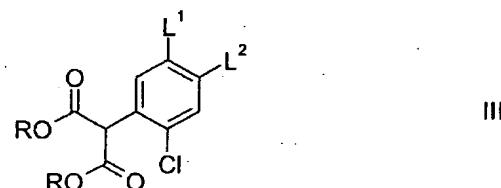
X is chlorine, methyl, cyano, methoxy or ethoxy and L¹ and L² are as defined in any of claims 1 to 5.

5

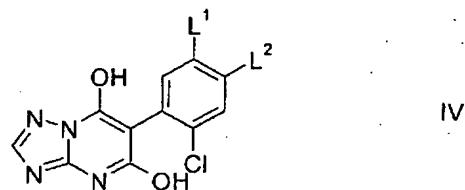
11. A process for preparing a compound of the formula I according to either of claims 1 to 7, in which X is halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy by reaction of 5-aminotriazole of the formula II



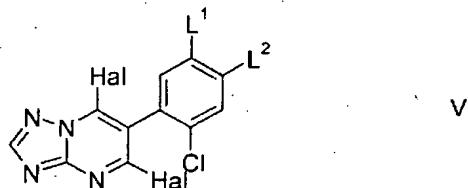
10 with phenylmalonates of the formula III



in which R is alkyl, to give dihydroxytriazolopyrimidines of the formula IV,



halogenation to give the dihalo compounds of the formula V,



15

and reaction of V with amines of the formula VI



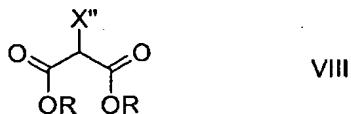
to give compounds of the formula I in which X is halogen, if desired, to prepare compounds I in which X is cyano, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₂-haloalkoxy, reaction of compounds I in which X is halogen with compounds of the formula VII,

20

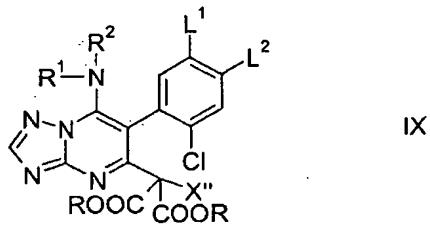
M-X'

VII

which, depending on the group X' to be introduced, are inorganic cyanides, alkoxides or haloalkoxides and in which M is an ammonium, tetraalkylammonium, alkali metal or alkaline earth metal cation, and, if desired, to prepare compounds of the formula I according to claim 1, in which X is alkyl, by reaction of the compounds I in which X is halogen with malonates of the formula VIII,

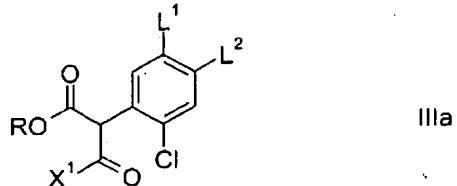


in which X'' is hydrogen or C₁-C₃-alkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give compounds of the formula IX

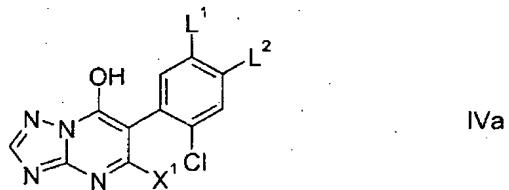


and decarboxylation to compounds I in which X is alkyl.

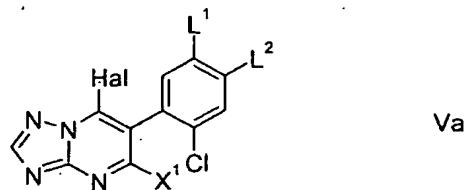
12. A process for preparing a compound of the formula I according to any of claims 1 to 6 in which X is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl by reaction of 5-aminotriazole of the formula II as set forth in claim 11 with keto esters of the formula IIIa,



in which X¹ is C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl and R is C₁-C₄-alkyl, to give 5-alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidines of the formula IVa,



20 halogenation of IVa to give 7-halotriazolopyrimidines of the formula Va



and reaction of Va with amines of the formula VI as set forth in claim 11 to give compounds I.

- 5 13. A compound of the formula IV, IVa, V or Va as set forth in claim 11 or 12.
14. A fungicidal composition, comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to any of claims 1 to 7.
- 10 15. Seed, comprising 1 to 1000 g of a compound of the formula I according to any of claims 1 to 3 per 100 kg.
- 15 16. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, which method comprises treating the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack with an effective amount of a compound of the formula I according to any of claims 1 to 7.

Europäisches
PatentamtEuropean
Patent officeOffice européen
des brevets

Absender:
BASF Aktiengesellschaft
Ludwigshafen 67056
Deutschland

D-80298 München
 (+49-89) 2399-0
 Tx 523 656 epmu d
 Fax (+49-89) 23 99-44 65
 P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk
 (+31-70) 340-2040
 Tx 31 651 epo nl
 Fax (+31-70) 340-30-16
 D-10958 Berlin
 (+49-30) 25901-0
 Fax (+49-30) 25901-840

BEGLEITSCHREIBEN FÜR DEN EINGANG NACHGEREICHTER UNTERLAGEN

Die nachstehend aufgeführten Unterlagen werden zu folgender Anmeldung nachgereicht:

Anmeldenummer

05700961.5

Zeichen des Anmelders oder Vertreters

PF 55279

	Beschreibung der Unterlage	Ursprünglicher Dateiname	Vergebener Dateiname
1	Übersetzung der Patentansprüche	55279 en.pdf	CLMSTRAN-1.pdf
2	Übersetzung der Patentansprüche	55279 fr.pdf	CLMSTRAN-2.pdf

	Gebühren	Angewandter Faktor	Gebührenverzeichnis	Zu zahlender Betrag
1	007 Erteilungsgebühr Insgesamt:	1	715.00 EUR	715.00 715.00

	Zahlung	
1	Zahlungsart: Währung: Hiermit wird das EPA ermächtigt, fällig werdende Gebühren und Auslagen nach Maßgabe der Vorschriften über das automatische Abbuchungsverfahren von nachstehenden laufenden Konto abzubuchen. Bennenungsgebühren siehe Seite "Staaten". Außerdem wird das EPA ermächtigt, bei Ablauf der Grundfrist für die Entrichtung der Erstreckungsgebühren diese Gebühren für jeden auf der Seite "Staaten" angegebenen Erstreckungsstaat abzubuchen, sofern es vor Ablauf dieser Frist keine anderslautenden Anweisungen erhält. Nummer des laufenden Kontos: Kontoinhaber:	Automatischer Abbuchungsauftrag EUR
2	Rückerstattung/Rückzahlung Etwaige Rückzahlungen auf laufendes Konto beim EPA:	28000009 BASF Aktiengesellschaft

Kontoinhaber: | BASF Aktiengesellschaft

Anmerkungen

Patentschrift(Reininger: Appl.; 26.01.2006)

1. Bemerkung (Anmerkungen)

Gemäß Beschluss des Präsidenten vom 22.12.2004 beantragen wir hiermit, dass uns eine Kopie der Patentschrift zusammen mit der Urkunde über das europäische Patent zugesandt wird.

Gebühren(Reininger: Appl.; 26.01.2006)

2: Bemerkung (Anmerkungen)

Diese Anmeldung nimmt am automatischen Abbuchungsverfahren teil. Bitte buchen Sie alle Gebühren von unserem laufenden Konto Nr. 28000009.

Erklärung

Hiermit wird erklärt, dass die nachgereichten Unterlagen KEINE Mitteilung enthalten oder enthalten sollen, die sich auf eine Beschwerde oder einen Einspruch bezieht (ABI. EPA 2003, 609: "... Bis auf weiteres bleiben Einspruchs- und Beschwerdeverfahren von dieser Möglichkeit ausgenommen; die elektronische Einreichung von Schriftstücken ist demzufolge in diesen Verfahren nicht zulässig.")

Unterschriften

Ort:

Datum: 21.Mai 2007

Unterzeichnet von: DE, BASF AG, C. Reininger 2738

in Eigenschaft als: (Angestellte(r) von BASF Aktiengesellschaft)

Europäisches Patentamt
GD2

European Patent Office
DG2

Office européen des brevets
DG2

Anmeldenummer:

05 700 961.5

IV.1 Unterlagen für die Patenterteilung

In der Fassung für die Vertragsstaaten:

AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IS IT LI LT LU MC NL PL PT RO SE SI SK TR

Beschreibung, Seiten

1-22 1-13, 23-32
14, 22

ursprüngliche Fassung
eingegangen am 5.3.07 mit Schreiben vom 2.3.07

Ansprüche, Nr.

1-16

ursprüngliche Fassung

*) Seiten 15-21 auf Antrag der Anmelderin gestrichen.

Europäische Patentanmeldung Nr.

- Antrag auf Änderung/Berichtigung der Unterlagen vom 02.03.07
 Einwendungen Dritter nach Artikel 115 EPÜ vom
 Weiter mit Punkt 3.

1. Antrag auf Änderungen nach Regel 86 (3) EPÜ oder Berichtigungen nach Regel 88 EPÜ
Hinweis für Prüfer: falls 1.1.3 auf Formblatt 2092A.1 angekreuzt ist, dürfen Änderungen/Berichtigungen nur in bestimmten Ausnahmefällen gemacht werden (siehe Richtlinien C-VI, 4.10).

An den Formalprüfer

- 1.1 Den beantragten Änderungen/Berichtigungen wird zugestimmt. Das Erteilungsverfahren wird fortgesetzt. CORI 2 ist zu kodieren. Formblatt 2098A ist abzusenden. (Weiter mit Punkt 4.)
 1.2 Nach telefonischer Rücksprache wurde Einvernehmen erreicht. Das Erteilungsverfahren wird fortgesetzt. CORI 2 ist zu kodieren. Beigefügtes Formblatt 2036 (telefonische Rücksprache) ist mit Formblatt 2098A abzusenden. (Weiter mit Punkt 4.)
 1.3 Den beantragten Änderungen/Berichtigungen wird nicht zugestimmt.
 1.3a Beigefügter Bescheid auf Formblatt 2001 ist abzusenden (EXRE). (Prüfer kann bei weiteren Änderungen der Patentansprüche Standardformulierung N16/N17 verwenden.)
 Beigefügtes Formblatt 2036/2049 (telefonische Rücksprache) ist abzusenden (EXRE). (Prüfer kann bei weiteren Änderungen der Patentansprüche Standardformulierung N16/N17 verwenden.)
 Übersetzung der Patentansprüche erforderlich (im Prüfungsbescheid oder der telefonischen Rücksprache erwähnt). CLTR ist mit demselben Datum wie Formblatt 2001/2049 zu kodieren.

29/5/07
 1. Prüfer (zu 1.3a), Datum

An die Prüfungsabteilung

- 1.3b Antwortschreiben des Anmelders auf Bescheid (Formblatt 2001)/telefonische Rücksprache (Formblatt 2036) vom eingegangen am
 Weiteres Verfahren je nach Sachlage unter Punkten 1.3c, e-h.

An den Formalprüfer

- Wenn dem Änderungsantrag nicht stattgegeben werden kann:
 1.3c Der Anmelder hat die Mängel nicht beseitigt.
 Beigefügter Bescheid auf Formblatt 2001 ist abzusenden (EXRE). (Prüfer kann bei weiteren Änderungen der Patentansprüche Standardformulierung N16/N17 verwenden.)
 Beigefügtes Formblatt 2036/2049 (telefonische Rücksprache) ist abzusenden (EXRE). (Prüfer kann bei weiteren Änderungen der Patentansprüche Standardformulierung N16/N17 verwenden.)
 Übersetzung der Patentansprüche erforderlich (im Prüfungsbescheid oder der telefonischen Rücksprache erwähnt). CLTR ist mit demselben Datum wie Formblatt 2001/2049 zu kodieren.

1. Prüfer (zu 1.3c), Datum

An die Prüfungsabteilung

- 1.3d Antwortschreiben des Anmelders auf Bescheid (Formblatt 2001)/telefonische Rücksprache (Formblatt 2036) vom eingegangen am

An den Formalprüfer **Wenn die Prüfungsabteilung eine abschliessende Entscheidung treffen kann:**

- 1.3e Der Antrag auf Änderungen/Berichtigungen wurde zurückgenommen. Die Anmeldung ist ohne Änderungen erteilungsreif (sofern die richtigen Übersetzungen vorliegen). CORI ist zu löschen. (Unterschrift unten.)
- 1.3f Der Antrag auf Änderungen/Berichtigungen wurde zurückgenommen. Übersetzungen der gewährbaren Patentansprüche fehlen. CLTR ist zu kodieren. Der Anmelder ist mit Formblatt 2093A zur Einreichung der Übersetzungen aufzufordern. Die Anmeldung ist erteilungsreif, wenn die Übersetzungen vorliegen. Nach deren Einreichung ist CORI zu löschen. (Unterschrift unten.)
- 1.3g Der Anmelder hat die Mängel beseitigt. Das Erteilungsverfahren wird fortgesetzt (sofern die richtigen Übersetzungen vorliegen). CORI 2 ist zu kodieren. Formblatt 2098A ist abzusenden. (Weiter mit Punkt 4.)
- 1.3h Der Anmelder hat die Mängel nicht beseitigt. Die Anmeldung ist zurückzuweisen. Beigefügte Zurückweisung mit Begründung (Formblatt 2007) (REFU) ist abzusenden.

2. Das Prüfungsverfahren wird ausnahmsweise wieder aufgenommen aufgrund der Richtlinien C-VI 15.5 weil

- der Prüfungsabteilung weiterer relevanter Stand der Technik bekannt geworden ist.
- die Mitteilung nach Regel 51(4) EPÜ der erste Bescheid war und der Anmelder nicht gewährbare Änderungen eingereicht hat.

An den Formalprüfer

IGRA, CORI und B99 (mit Mesy) sind zu löschen. Formblatt 2911D ist abzusenden. Die Papierakte ist an den 1. Prüfer zurückzuschicken. (Unterschrift unten.)

3. Einwendungen Dritter (Artikel 115 EPÜ)

- 3.1 Die Einwendungen nach Artikel 115 EPÜ machen keine Änderung der Unterlagen erforderlich. (Unterschrift unten.)
- 3.2 Das Prüfungsverfahren wird wieder aufgenommen (siehe Richtlinien C-VI, 15.5).

An den Formalprüfer

IGRA, CORI und B99 (mit Mesy) sind zu löschen; der Anmelder ist mit Formblatt 2911D zu informieren und die Papierakte an den 1. Prüfer zurückzuschicken. (Unterschrift unten.)

4. Erledigungsvermerk der Prüfungsabteilung

Das Druckexemplar, Formblatt 2035.3 und ggf. Titel auf Formblatt 2035.4/2056 wurden geändert.

<u>(9/06/07)</u> Datum	<u>Oey</u> 2. Prüfer	<u>bu</u> 1. Prüfer	<u>rechtskundiges Mitglied</u>
Vorsitzender			

(Unterschrift(en) zu 1.1, 1.2, 1.3e-g, 2, 3.1, 3.2, 4 auf Formblatt 2092A.2 und 2092A.3)



Europäisches Patentamt
80298 MÜNCHEN
DEUTSCHLAND
Tel.: +49 89 2399 - 0
Fax: +49 89 2399 - 4465

Europäisches
Patentamt

European
Patent Office

Office européen
des brevets



BASF Aktiengesellschaft
Patente, Marken und Lizenzen
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Formalsachbearbeiter

Name: Ullrich

Tel.: 8048

Datum

26-06-2007

Zeichen PF0000055279	Anmeldung Nr./Patent Nr. 05700961.5 - 2117
Anmelder/Patentinhaber BASF Aktiengesellschaft	

Kurzmitteilung

Antrag auf Änderung der Unterlagen vom 02.03.07

Dem Antrag auf Änderung nach Regel 86(3) EPÜ/Berichtigung nach Regel 88 EPÜ wurde stattgegeben.

- Die geänderten Seiten wurden ausgetauscht.
 Eine Kopie der beantragten Änderungen/Berichtigungen ist beigefügt.

Für die Prüfungsabteilung





Europäisches Patentamt
80298 MÜNCHEN
DEUTSCHLAND
Tel.: +49 89 2399 - 0
Fax: +49 89 2399 - 4465

Europäisches
Patentamt

European
Patent Office

Office européen
des brevets



BASF Aktiengesellschaft
Patente, Marken und Lizenzen
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Formalsachbearbeiter

Name:

Tel.:

Datum

05.07.07

Zeichen PF0000055279	Anmeldung Nr./Patent Nr. 05700961.5 - 2117 / 1725557
Anmelder/Patentinhaber BASF Aktiengesellschaft	

Entscheidung über die Erteilung eines Europäischen Patents gemäß Art. 97(2) EPÜ

Nach Prüfung der europäischen Patentanmeldung Nr. 05700961.5 wird für die benannten Vertragsstaaten ein europäisches Patent mit der Bezeichnung und mit den Unterlagen erteilt, die in der gemäß Regel 51(4) EPÜ ergangenen Mitteilung vom 08.02.07 aufgeführt sind.

Der am 05.03.07 beim EPA eingegangene Antrag auf Änderungen und etwaige spätere mit dem Anmelder vereinbarte Änderungen wurden berücksichtigt.

Patentnummer : 1725557
Anmeldetag : 15.01.05
Beanspruchte Priorität : 23.01.04/DEA102004003732
19.10.04/DEA102004051101

Benannte Vertragsstaaten
und Patentinhaber : AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IS IT LI LT LU
MC NL PL PT RO SE SI SK TR
BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen/DE

Die Entscheidung wird an dem Tag wirksam, an dem im Europäischen Patentblatt auf die Erteilung hingewiesen worden ist (Art. 97(4) und (5) EPÜ).

Der Hinweis über die Erteilung wird im Europäischen Patentblatt 07/31 am 01.08.07 bekannt gemacht.

Prüfungsabteilung

Rudolf M

Wolf C

Herz C



ANMERKUNG ZUR ENTSCHEIDUNG ÜBER DIE ERTEILUNG EINES EUROPÄISCHEN PATENTS (EPA Form 2006)

1. **EPA Informationsbroschüre "Nationales Recht zum EPÜ"**
Diese Broschüre enthält nützliche Informationen zu den formalen Erfordernissen und den Handlungen, die vor den Patentbehörden der Vertragsstaaten vorzunehmen sind, um Rechte in diesen Staaten zu erlangen. Da diese Handlungen einem ständigen Wandel unterworfen sind, sollte immer nur die neueste Ausgabe der Broschüre benutzt werden. Nachträgliche Informationen werden im Amtsblatt veröffentlicht.
2. **Übersetzung der europäischen Patentschrift nach Artikel 65(1) des Europäischen Patentüber-einkommens**
Sie werden erneut darauf hingewiesen, dass bestimmte Vertragsstaaten nach Artikel 65(1) EPÜ eine Übersetzung der europäischen Patentschrift verlangen; hierauf wird in der Mitteilung gemäss Regel 51(6) verwiesen. Die Nichteinreichung dieser Übersetzung kann zur Folge haben, dass das Patent in dem betreffenden Staat/in den betreffenden Staaten als von Anfang an nicht eingetreten gilt. Weitere Einzelheiten entnehmen Sie bitte der oben genannten Broschüre.
3. **Zahlung von Jahresgebühren für europäische Patente**
Nach Artikel 141 EPÜ können "nationale" Jahresgebühren für das europäische Patent für die Jahre erhoben werden, die an das Jahr anschliessen, in dem der Hinweis auf die Erteilung des europäischen Patents im "Europäischen Patentblatt" bekanntgemacht wird. Weitere Einzelheiten entnehmen Sie bitte der oben genannten Broschüre.

NOTE RELATING TO THE DECISION TO GRANT A EUROPEAN PATENT (EPO Form 2006)

1. **EPO Information Brochure "National law relating to the EPC"**
This brochure provides useful information regarding formal requirements and the steps to be taken before the patent authorities of the Contracting States in order to acquire rights in those states. Since the necessary steps are subject to change the latest edition of the brochure should always be used. Subsequent information is published in the Official Journal.
2. **Translation of the European patent specification under Article 65(1) of the European Patent Convention**
Your attention is again drawn to the requirements regarding translation of the European patent specification laid down by a number of Contracting States under Article 65(1) EPC, to which reference is made in the communication under Rule 51(6). Failure to supply such translation(s) may result in the patent being deemed to be void "ab initio" in the State(s) in question. For further details you are recommended to consult the above-mentioned brochure.
3. **Payment of renewal fees for European patents**
Under Article 141 EPC "national" renewal fees in respect of a European patent may be imposed for the years which follow that in which the mention of the grant of the European patent is published in the "European Patent Bulletin". For further details you are recommended to consult the above-mentioned brochure.

REMARQUE RELATIVE A LA DECISION DE DELIVRANCE D'UN BREVET EUROPEEN (OEB Form 2006)

1. **Brochure d'information de l'OEB "Droit national relatif à la CBE"**
Cette brochure fournit d'utiles renseignements sur les conditions de forme requises et sur les actes à accomplir auprès des offices de brevet des Etats contractants aux fins d'obtenir des droits dans les Etats contractants. Etant donné que les actes indispensables sont susceptibles de modifications, il serait bon de toujours consulter la dernière édition de la brochure. Toute information ultérieure est publiée au Journal Officiel.
2. **Traduction du fascicule du brevet européen en vertu de l'article 65(1) de la Convention sur le brevet européen**
Votre attention est de nouveau attirée sur l'obligation faite par certains Etats contractants, en vertu de l'article 65(1) CBE, de fournir une traduction du fascicule du brevet européen, à laquelle il est fait référence dans la notification établie conformément à la règle 51(6). Si la(les) traduction(s) n'est(ne sont) pas fournie(s), le brevet européen peut, dès l'origine, être réputé sans effet dans cet(ces) Etat(s). Pour plus de détails, nous vous renvoyons à la brochure susmentionnée.
3. **Paiement des taxes annuelles pour le brevet européen**
Conformément à l'article 141 CBE, les taxes annuelles "nationales" dues au titre du brevet européen peuvent être perçues pour les années suivant celle au cours de laquelle la mention de la délivrance du brevet européen est publiée au "Bulletin européen des brevets". Pour plus de détails, nous vous renvoyons à la brochure susmentionnée.



Europäisches
Patentamt
Europäische
Patent Office
Office européen
des brevets

Europäisches Patentamt
80298 MÜNCHEN
DEUTSCHLAND
Tel. +49 (0)89 2399 - 0
Fax +49 (0)89 2399 - 4465



BASF SE
Global Intellectual Property
GVX / K- C 6
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Bei Fragen zu dieser
Mitteilung:
Tel.: +31 (0)70 340 45 00

Datum	01.02.08
Zeichen PF0000055279	Anmeldung Nr./Patent Nr. 05700961.5 - 2117 / 1725557
Anmelder/Patentinhaber BASF SE	

Mitteilung

Über die Eintragung von Änderungen betreffend

- einen Rechtsübergang (R. 22 und 85 EPÜ)
 Angaben über den Anmelder / den Patentinhaber (R. 143 (1) f) EPÜ)

Antragsgemäß wurden die Angaben über den Anmelder der oben genannten europäischen Patentanmeldung / den Patentinhaber des oben genannten europäischen Patents wie folgt geändert:

AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IS IT LI LT LU MC NL
PL PT RO SE SI SK TR
BASF SE
67056 Ludwigshafen/DE

Die Eintragung der geänderten Daten ist mit Wirkung vom 19.01.08 erfolgt.

Soweit es sich um eine bereits veröffentlichte Patentanmeldung / um ein Patent handelt, wird die Änderung in das Europäische Patentregister eingetragen und im Europäischen Patentblatt (Abschnitt I.12 / II.12) veröffentlicht.

Es wird darauf hingewiesen, dass im Falle der Eintragung eines Rechtsübergangs ein eventueller automatischer Abbuchungsauftrag erst am Tag des ausdrücklichen Widerrufs seine Wirkung verliert (vgl. Punkt 14 c) der Vorschriften über das automatische Abbuchungsverfahren, Beilage zum Abl. EPA 10/2007).

Kundendatenverwaltung
Tel.: +49 (0)89 2399 2780

